

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平6-24956

(43) 公開日 平成6年(1994)2月1日

(51) Int. Cl. ⁵	識別記号	F I
A61K 7/48	9051-4C	
7/00	H 9164-4C	
	J 9164-4C	
	W 9164-4C	
	U 9164-4C	

審査請求 未請求 請求項の数2 (全9頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平4-227723

(22) 出願日 平成4年(1992)7月13日

(71) 出願人 000001959

株式会社資生堂

東京都中央区銀座7丁目5番5号

(72) 発明者 柳田 威

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株

式会社資生堂研究所内

(72) 発明者 阪本 興彦

神奈川県横浜市港北区新羽町1050番地 株

式会社資生堂研究所内

(54) 【発明の名称】 皮膚外用剤

(57) 【要約】

【目的】 肌荒れ改善効果の相乗的に向上した皮膚外用剤を提供することを目的とする。

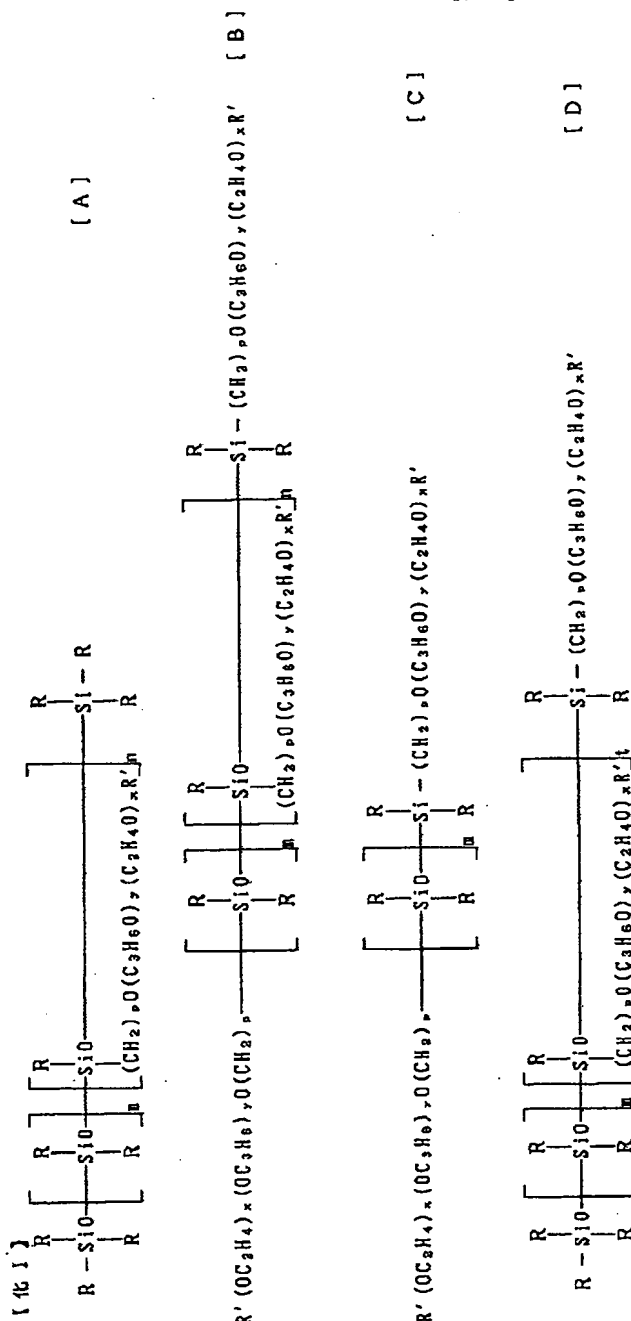
【構成】 ビタミンAとポリオキシアルキレン変成オルガノポリシロキサンを配合。

【特許請求の範囲】

【請求項1】ビタミンAとポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンとを含有することを特徴とする皮膚外用剤。

【請求項2】ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンが、下記一般式、化Iで表される化合物より選ばれたものである請求項1記載の皮膚外用剤。

【化 I】



式(1)中、 R は炭素数1乃至3のアール基、 p は1乃至5の整数である。 m は5乃至100の整数、 n および x は1乃至12のアール基、 t および y は0乃至50の整数である。)

【発明の詳細な説明】

[0 0 0 1]

【産業上の利用分野】本発明は皮膚外用剤に関し、さらに詳しくはビタミンAとポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンとを含有することによりビタミンAのもつ肌荒れ改善効果を相乗的に向上させるとともに安全性にも配慮した皮膚外用剤に関する。

【0 0 0 2】

【従来の技術】皮膚外用剤には種々の薬効成分が配合されている。その中で皮膚の加齢、あるいは日光暴露等による変化を予防、改善する効果も薬効の一つであり、これらを目的とする化粧料等の皮膚外用剤が求められてきた。

【0003】こうした中で従来は、天然物から抽出した各種原料、例えばタンパク質、多糖、抽出エキス、天然高分子等がその使用効果が特徴的であるため皮膚外用剤

に配合されてきた。

【0004】近年、ビタミンAおよびその誘導体の中から選ばれる一種または二種以上を配合し、皮膚の加齢あるいは日光暴露による変化、あるいは障害を防止、改善する方法が開陳されている。(特表昭64-500355)

【0005】

【発明が解決しようとする課題】

従来技術の問題点

しかしながら、その効果は十分ではなく、より優れた効果のある薬剤の開発が待望されていた。

【0006】発明の目的

本発明は前記従来技術の問題点に鑑みなされたものであり、その目的は、皮膚の加齢あるいは日光暴露による変化、あるいは障害に対する防止効果、改善効果等の肌荒れ改善効果を十分発揮させる皮膚外用剤を提供することにある。

【0007】前記目的を達成するために、本発明者らは安全性に優れた物質の中から、特に十分な肌荒れ改善効果を発現させる物質を得るべく鋭意研究を重ねた結果、
20 ビタミンAと共にポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンを配合することによって、これら問題点を解決することを見出した。

【0008】本発明者らは上記知見に基いて本発明を完成するに至った。

【0009】

【課題を解決するための手段】すなわち、本発明はビタミンAとポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンとを含有することを特徴とする皮膚外用剤を提供するものである。以下、本発明の構成について詳述する。

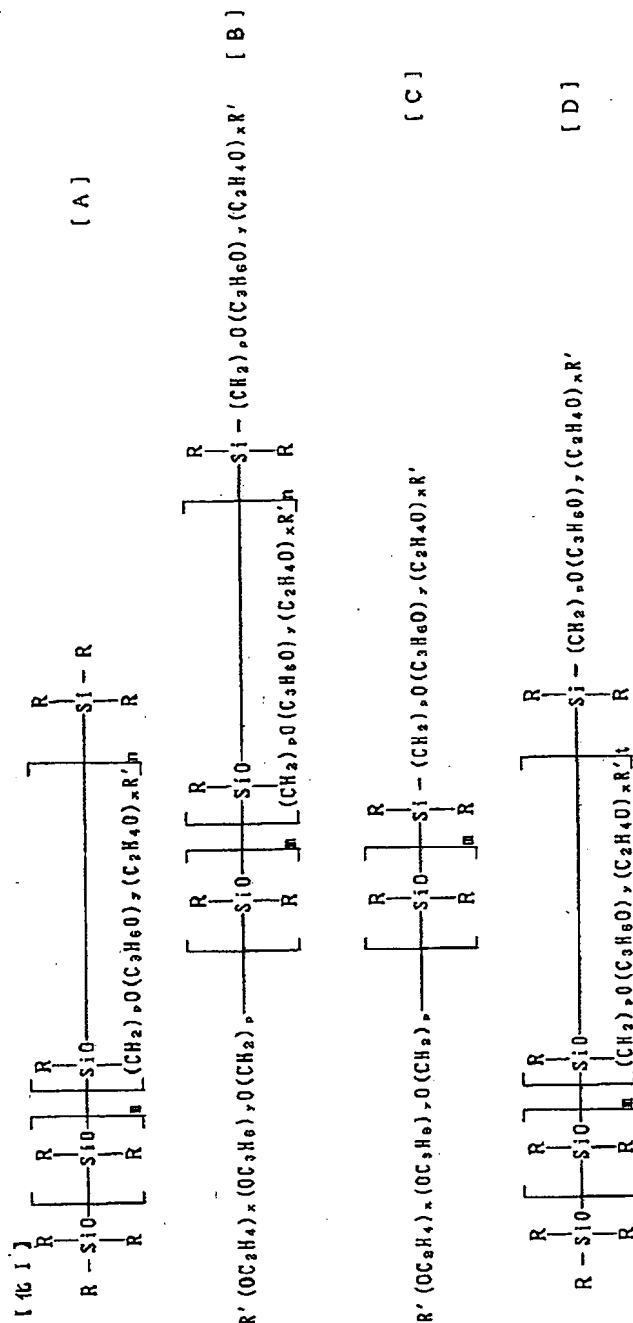
【0010】本発明に用いられるビタミンAは別名をレチノールとも言い、通常、医薬品分野等で小児病、夜盲症の治療や妊娠後の回復剤として利用されている。これらの中でall-trans体もしくは13-cis体を用いることが望ましく、それらの混合物を使用してもかまわない。

【0011】本発明の皮膚外用剤へのビタミンAの配合量については限定はしないが、ビタミンAの肌への効果を考えると0.00001重量%~5.0重量%が好ましく、0.0001重量%~0.5重量%がより好ましい。

【0012】本発明に用いられるポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンは、下記一般式、化Iで表される化合物である。

【0013】

【化I】

[illegible]

【0014】本発明に用いられるポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンの平均分子量は特に限定しないが、3000以上を有するものが好ましく、更に好ましくは5000以上である。また、ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン分子中にポリオキシアルキレン基を2～80重量%含有するものが好ましく、効果発現の面から更に好ましくは、11～50重量%である。

【００１５】ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンは、皮膚外用剤全量中、０．１～２０重量％、好ましくは０．２～１０重量％である。０．１重量％未満では皮膚刺激性が低くならない。また、２０

重量%を越えると皮膚外用剤としての品質が保てなくなる。

【0016】本発明の皮膚外用剤は前記の必須成分に加えて、必要に応じ、本発明の効果を損なわない範囲内で、化粧料、医薬部外品、医薬品等に一般に用いられる各種成分、水性成分、保湿剤、増粘剤、紫外線吸収剤、防腐剤、酸化防止剤、香料、色剤、薬剤、生薬、等が配合される。もちろんこれらは本発明の目的を損なわない質的、量的条件下で使用されなければならない。

【0017】また本発明の皮膚外用剤の剤型は任意であり、例えば化粧水等の可溶化系、乳液、クリーム等の乳化系あるいは軟膏、粉末分散系、水—油二層系、水—油

一粉末三層系等のような剤型でもかまわない。

【0018】

【実施例】次に実施例および比較例をあげて、本発明を具体的に明らかにする。尚、本発明はこれにより限定されるものではない。配合量は重量%である。

(1) セトステアリルアルコール	3.5
(2) スクワラン	30.0
(3) ミツロウ	3.0
(4) 還元ラノリン	5.0
(5) エチルパラベン	0.3
(6) ポリオキシエチレン (50モル) オレイルアルコールエーテル	2.0
(7) ステアリン酸モノグリセリド	2.0
(8) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン (表1に記載)	3.0
(9) 香料	0.03
(10) ビタミンA	0.0001
(11) グリセリン	15.0
(12) 精製水	残余

製法

(1)、(2)、(3)、(4)、(5)、(6)、(7)、(8)、(9)、(10)を加熱溶解し、75℃に保ったものを75℃に加温した(11)、(12)に攪拌しながら加える。ホモミキサーで攪拌乳化しながら冷却してクリームを得た。

【0020】<<比較例1>>実施例1の処方からポリ

20 オキシアルキレン変性オルガノポリシロキサンを除いた以外は全て同じ処方。

【0021】<<比較例2>>実施例1の処方からビタミンAを除いた以外は全て同じ処方。

【0022】

【表1】

	ポリオキシアルキレン変性 オルガノシロキサン
実施例 1	一般式[A] ポリオキシエチレン基20重量% 分子量6000
実施例 2	一般式[A] ポリオキシエチレン基40重量% 分子量20000
実施例 3	一般式[B] ポリオキシエチレン基60重量% 分子量10000
実施例 4	一般式[C] ポリオキシエチレン基20重量% ポリオキシプロピレン基10重量% 分子量4000
実施例 5	一般式[A] ポリオキシエチレン基15重量% 分子量2500

【0023】<肌荒れ改善試験方法>乾癬様、肌荒れ様の皮膚疾患を有する被験者100名をパネルとして5群に分け、1群(1群20名)ごとに実施例1~5及び比較例1~2のクリームを使用させた。すなわち実施例1~5を、パネルの左顔面へ1日2回ずつ塗布し、比較例

1と比較例2のクリームを右顔面に塗布させ、3ヶ月連続使用後、使用前に比べて使用後の全般改善度を肉眼判定した。その結果を表2に示す。

【0024】

【表2】

実使用試験結果 (全般改善度)

全般改善度	実 施 例										比 較 例			
	1		2		3		4		5		1		2	
	乾	肌荒れ	乾	肌荒れ	乾	肌荒れ	乾	肌荒れ	乾	肌荒れ	乾	肌荒れ	乾	肌荒れ
かなり改善	7	6	6	6	6	7	6	6	5	5	0	0	0	0
やや改善	2	2	3	2	1	2	2	2	3	3	4	4	1	1
変化なし	1	2	1	2	3	1	2	2	2	2	19	19	24	24
悪化	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	2	2	0	0
合計(人数)	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	25	25	25	25
有効度(%) (やや改善以上のもの)	90	80	90	80	70	90	80	80	80	80	16	16	4	4

【0025】表2の結果から明らかなように実施例1～5の本発明品は比較例1、比較例2のものに比べて相乗的に優れた肌荒れ改善効果を有していることがわかった。

【0026】

実施例6 化粧水

重量%

(1) ビタミンA	0.00001
(2) ポリオキシアルキレン変性 オルガノポリシロキサン*1	0.1
(3) グリセリン	1.0
(4) 精製水	残余
(5) エタノール	7.0
(6) ポリオキシエチレン(50モル)オレイルアルコールエーテル	1.0
(7) メチルパラベン	0.05
(8) オレイルアルコール	1.0
(9) 乳酸	0.01
(10) 乳酸ナトリウム	0.1
(11) 香料	0.01

(製法) 精製水に(3)、(9)、(10)を溶解する。別にエタノールに(1)、(2)、(6)、(7)、(11)を溶解し、これを前記の精製水に加えて溶解し濾過し化粧水を得た。

40 本発明の化粧水は肌荒れ改善効果に優れていた。

【0027】

*1 一般式[B]
ポリオキシエチレン基60重量%
分子量10000

実施例7 バック

重量%

(1) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン *2	3.0
--------------------------------	-----

11	12
(2) ポリビニルアルコール	10.0
(3) プロピレングリコール	7.0
(4) エタノール	10.0
(5) ビタミンA	0.01
(6) メチルパラベン	0.05
(7) POE (60モル) 硬化ひまし油	0.2
(8) 香料	0.05
(9) 精製水	残余

*2

一般式[A]
ポリオキシエチレン基40重量%
分子量8000

製法

10 (9)に(1)、(3)、(6)、(7)を加え攪拌溶解する。次に(2)を加え加熱攪拌し、(9)を溶解した、(4)を加え攪拌溶解してパックを得た。本発明のパックは皮膚改善効果に優れていた。

[0028]

実施例8 固型白粉

	重量%
(1) ビタミンA	0.0005
(2) タルク	85.4
(3) ステアリン酸	2.5
(4) スクワラン	3.5
(5) ソルビタンセスキオレイン酸エステル	1.8
(6) トリエタノールアミン	1.2
(7) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン *3	10.0
(8) 顔料	適量
(9) 香料	適量

*3

一般式[B]
ポリオキシエチレン基60重量%
分子量4000

30 70℃に保つ。(水相)香料を除く本発明かの成分を混合し、加熱溶解して70℃に保つ。(油相)水相に油相を加えホモミキサーで均一に乳化し、これを粉末部に加えニーダーで練り併せた後、水分を蒸発させ粉砕機で処理する。さらにこれをよく掻き交ぜながら香料を均一に噴霧し圧縮成形する。本発明の固型白粉は皮膚に対する改善効果に優れていた。

[0029]

製法

タルク、顔料をニーダーで十分混合する。(粉末部)トリエタノールアミンを50%相当量の精製水に加え70

実施例9 口紅

	重量%
(1) ビタミンA	0.00001
(2) マイクロクリスタリンワックス	3.0
(3) ミツロウ	3.0
(4) セレシンワックス	5.0
(5) 流動パラフィン	19.0
(6) スクワラン	20.0
(7) カルナバロウ	3.0
(8) キャンデリラロウ	3.0
(9) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン *4	1.0
(10) 調合色剤	7.0
(11) ジブチルヒドロキシトルエン	0.05
(12) 香料	適量
(13) ラノリン	残余

#4

一般式[A]
ポリオキシエチレン基60重量%
分子量25000

製法

常法により口紅を得た

本発明の口紅はくちびるのかさつきを著しくおさえていた。

【0030】

実施例10 乳液	重量%
(1) ビタミンA	1.0
(2) ポリオキシアリキレン変性オルガノポリシロキサン *5	1.0
(3) エタノール	2.0
(4) グリセリン	10.0
(5) プロピレングリコール	3.0
(6) カルボキシビニルポリマー	0.3
(7) KOH	0.1
(8) メチルパラベン	0.1
(9) セタノール	2.5
(10) ワセリン	2.0
(11) スクワラン	10.0
(12) イソプロピルミリステート	5.0
(13) グリセリルモノステアレート	2.0
(14) POE (25モル) セチルエーテル	2.0
(15) 精製水	残余

#5

一般式[C]
ポリオキシエチレン基15重量%
ポリオキシプロピレン基10重量%
分子量5000

製法

改善効果に優れていた。

常法により本発明の乳液を得た。本発明の乳液は肌荒れ

【0031】

実施例11 乳液	重量%
(1) ビタミンA	0.3
(2) ポリオキシアリキレン変性オルガノポリシロキサン *6	0.2
(3) エタノール	5.0
(4) グリセリン	5.0
(5) プロピレングリコール	5.0
(6) カルボキシビニルポリマー	0.2
(7) KOH	0.06
(8) メチルパラベン	0.2
(9) POE (60モル) 硬化ひまし油	1.0
(10) スクワラン	3.0
(11) イソプロピルミリステート	3.0
(12) 精製水	残余

*6

一般式 [D]

ポリオキシエチレン基40重量%
分子量7000

製法

常法により本発明の乳液を得た。本発明の乳液は、皮膚改善効果に優れていた。

【0032】

実施例 1 2 ナイトクリーム

重量%

(1) スクワラン	20.0
(2) 流動パラフィン	10.0
(3) イソプロピルミリステート	6.0
(4) プチルパラベン	0.2
(5) ポリオキシアルキレン変性オルガノポリシロキサン *7	3.0
(6) ジグリセリンジイソステアレート	1.0
(7) ワセリン	4.0
(8) 固形パラフィン	2.0
(9) ビタミンA	0.3
(10) プロピレングリコール	4.0
(11) グリセリン	10.0
(12) 硫酸マグネシウム	0.3
(13) 精製水	残余

*7

一般式 [A]

ポリオキシエチレン基20重量%
分子量6000

常法により本発明のナイトクリームを得た。本発明のナイトクリームは、皮膚改善効果に優れていた。

【0033】

【発明の効果】本発明の皮膚外用剤は表皮障害を防止し、皮膚の加齢あるいは日光暴露による変化、あるいは障害を防止、改善する効果等の肌荒れ改善を相乗的に向上させ安全性にも配慮した皮膚外用剤である。

製法

フロントページの続き

(51) Int. Cl.⁵

A 6 1 K 7/02
7/025

識別記号 庁内整理番号

Z 9164-4C
9164-4C

F I

技術表示箇所